

- For more records, click the Records link at page end.
- To change the format of selected records, select format and click Display Selected.
- To print/save clean copies of selected records from browser click Print/Save Selected.
- To have records sent as hardcopy or via email, click Send Results.

✓ Select All

✗ Clear Selections

Print/Save Selected

Send Results

Format

Display Selected

Free

1. ☐ 9/5/1 DIALOG(R)File 352:Derwent WPI (c) 2006 Thomson Derwent. All rts. reserv.

009225323

WPI Acc No: 1992-352745/199243

XRAM Acc No: C92-156475

Hypoglycaemic drug contg. tea polyphenol(s) - e.g.

(-)epicatechin gallate, (-)epigallocatechin gallate, theaflavin, theaflavin mono-gallate A or B or theaflavin digallate

Patent Assignee: MITSUI NORIN CO LTD (MITS-N); MITSUI NORIN KK (MITS-N)

Inventor: HARA Y; ISHIGAKI A; MATSUMOTO N; TONO-OKA F

Number of Countries: 016 Number of Patents: 005

Patent Family:

Patent No	Kind	Date	Applicat No	Kind	Date	Week
JP 4253918	A	19920909	JP 9135177	A	19910205	199243 B
AU 638894	B	19930708	AU 9217333	A	19920602	199334 N
EP 573682	A1	19931215	EP 92109657	A	19920609	199350 N
CA 2070114	A	19931202	CA 2070114	A	19920601	199408 N
CA 2070114	C	20020820	CA 2070114	A	19920601	200263 N

Priority Applications (No Type Date): JP 9135177 A 19910205; AU 9217333 A 19920602; EP 92109657 A 19920609; CA 2070114 A 19920601

Cited Patents: 2. Jnl. Ref: EP 423419; JP 3083929

Patent Details:

Patent No	Kind	Lan	Pg	Main IPC	Filing Notes
JP 4253918	A		4	A61K-035/78	
AU 638894	B			A61K-035/78	
EP 573682	A1 E	9		A61K-031/35	

JP 4253918 A

AU 638894 B

EP 573682 A1 E

Designated States (Regional): AT BE CH DE DK ES FR GB GR IT LI NL SE

CA 2070114 A

CA 2070114 C E

Abstract (Basic): JP 4253918 A

Drug for inhibiting blood sugar increase contains tea polyphenols as an effective ingredient.

Pref. tea polyphenols are (-)epicatechin gallate,

(-)epigallocatechin gallate, free theaflavin, theaflavin monogallate A, theaflavin monogallate B and theaflavin digallate.

USE/ADVANTAGE - The drug is used as hypoglycaemic drug and causes no adverse reactions.

In an example, tablet comprises 100 mg of crude catechin or (-)epigallocatechin gallate, 80 mg of light anhydrous silicate, 140 mg of crystal cellulose, appropriate amount of lactose and 2 mg of magnesium stear

Dwg. 0/0

Title Terms: HYPOGLYCAEMIC; DRUG; CONTAIN; TEA; POLYPHENOL; EPI; CATECHIN; GALLATE; EPI; CATECHIN; GALLATE; MONO; GALLATE; DI; GALLATE

Derwent Class: B02

International Patent Class (Main): A61K-031/35; A61K-035/78

International Patent Class (Additional): C07D-311/62

File Segment: CPI

Derwent WPI (Dialog® File 352): (c) 2006 Thomson Derwent. All rights reserved.

✓ Select All

Format

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平4-253918

(43) 公開日 平成4年(1992)9月9日

(51) Int.Cl. ⁸	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
A 6 1 K 35/78	A D P C	7180-4C		
31/35		7475-4C		
C 0 7 D 311/62		6701-4C		

審査請求 未請求 請求項の数2(全4頁)

(21) 出願番号 特願平3-35177

(22) 出願日 平成3年(1991)2月5日

(71) 出願人 591039137

三井農林株式会社

東京都中央区日本橋室町3丁目1番20号

(72) 発明者 原 征彦

静岡県藤枝市南駿河台2-2-7

(72) 発明者 外岡 史子

静岡県静岡市大谷1455-3

(72) 発明者 石垣 明代

静岡県掛川市七日町126

(72) 発明者 松本 なつき

静岡県藤枝市稲川1-6-21 藤ハウス
201

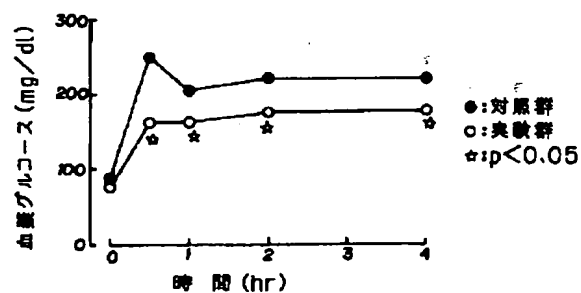
(74) 代理人 弁理士 久保田 藤郎

(54) 【発明の名称】 血糖上昇抑制剤

(57) 【要約】

【構成】 茶カテキン類や茶テアフラビン類などの茶ポリフェノールを有効成分とする血糖上昇抑制剤。

【効果】 本発明の血糖上昇抑制剤は、血糖上昇抑制作用に優れている上に、人体に対する副作用などの心配がなく、安心して使用できる。



1

【特許請求の範囲】

【請求項1】 茶ポリフェノールを有効成分とする血糖上昇抑制剤。

【請求項2】 茶ポリフェノールが(一)エピカテキンガレート、(一)エピガロカテキンガレート、遊離型テアフラビン、テアフラビンモノガレートA、テアフラビンモノガレートB及びテアフラビンジガレートの中から選ばれた少なくとも1種の物質である請求項1記載の血糖上昇抑制剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】 本発明は血糖上昇抑制剤に関し、詳しくは茶ポリフェノールを有効成分とする血糖上昇抑制剤に関する。

【0002】

【従来の技術】 微生物由来の特定の糖ペプチドやオリゴ糖などが血糖上昇抑制作用を有することが報告されているが、これらは副作用があったり、大量摂取あるいは継続摂取した場合の人体への影響など安全性の面で問題があり、実用化されるに至っていない。

【0003】 なお、本発明者らは多糖を加水分解する消化酵素である α -アミラーゼの活性を茶ポリフェノールが阻害する作用を有することを知見して特許出願した(特願平1-270228)。しかし、このことから直ちに茶ポリフェノールが血糖上昇抑制作用を有することは予測されない。

【0004】

【発明が解決しようとする課題】 本発明は、十分な血糖上昇抑制作用を有しており、人体に対し有害な副作用がなく安心して使用できる薬剤を開発することを目的とする。

【0005】

【課題を解決するための手段】 そこで、本発明者らは天然物の中から目的とする薬効を有する物質を検索すべく検討した。我々は既に茶葉より茶ポリフェノールを効率よく採取する方法の確立に成功しており、その生理活性についても研究を重ねた結果、茶ポリフェノールが優れた血糖上昇抑制作用を有することを見出し、かかる知見に基づいて本発明を完成するに至った。

【0006】 本発明は、茶ポリフェノールを有効成分とする血糖上昇抑制剤である。茶ポリフェノール類は下記の一般式(1)で表される茶カテキン類と一般式(2)

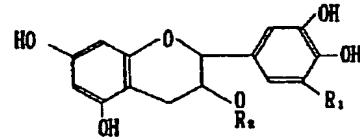
【化5】

2

で表される茶テアフラビン類を意味する。

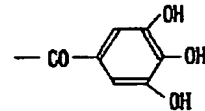
【0007】 一般式(1)

【化1】

【0008】 (式中、R₁ はHまたはOHを示し、R₂

10 はHまたは

【化2】



を示す。)

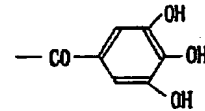
【0009】 カテキン類を具体的に示すと、以下のものがある。

(一) エピカテキン (一般式(1)中、R₁ = H, R₂ = Hのもの)

20 (一) エピガロカテキン (一般式(1)中、R₁ = OH, R₂ = Hのもの)

(一) エピカテキンガレート (一般式(1)中、R₁ = H, R₂ =

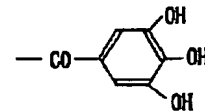
【化3】



30 のもの)

(一) エピガロカテキンガレート (一般式(1)中、R₁ = OH, R₂ =

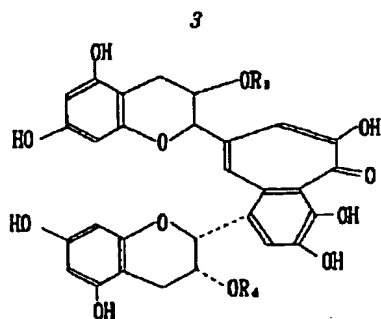
【化4】



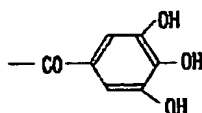
のもの)

40 なお、後記するポリフェノン100(三井農林株式会社製)は上記4種類の茶カテキン類の混合物である。

【0010】 一般式(2)



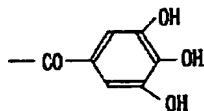
【0011】(式中、 R_3 及び R_4 はHまたは
【化6】



を示し、 R_3 及び R_4 は同じであっても異なってもよい。)

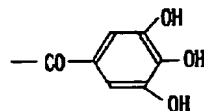
【0012】テアフラビン類を具体的に示すと、以下の

ものがある。遊離型テアフラビン (一般式(2)中、 $R_3 = H$, $R_4 = H$ のもの) テアフラビンモノガラート
A (一般式(2)中、 $R_3 =$
【化7】



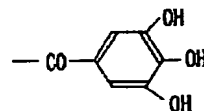
, $R_4 = H$ のもの)

テアフラビンモノガラートB (一般式(2)中、 $R_3 = H$, $R_4 =$
【化8】



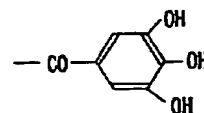
のもの)

テアフラビンジガラート (一般式(2)中、 $R_3 =$
【化9】



, $R_4 =$

【化10】



のもの)

【0013】上記茶ポリフェノールは茶葉を原料として
製造することができ、その製法は特開昭59-2193 50

4

84号公報、同60-13780号公報、同61-130285号公報などに記載されている。

【0014】本発明の血糖上昇抑制剤を薬剤として用いたり、食品等に添加する場合、主成分の茶ポリフェノールを直接、あるいは水、アルコールなどに溶解して混合すればよい。さらには、適当な賦形剤、増量剤などの常用の成分と組み合わせて用いることもできる。本発明の血糖上昇抑制剤を人体に投与する場合、主成分の茶ポリフェノールは十分な血糖上昇抑制作用が得られる範囲で使用すればよく、通常は1日量2~5g程度を経口的に服用することが好ましい。

【0015】

【実施例】次に、本発明を実施例により詳しく説明するが、本発明はこれらにより制限されるものではない。

実験例1

一晚絶食させたウィスター系雄ラットに40%可溶性でんぶん水溶液4ml及びポリフェノン100(三井農林株式会社製)80mgを同時に経口投与し、これを実験群とした。一方、対照群には40%可溶性でんぶん水溶液4mlを経口投与した。

【0016】投与の直後、30分後、1時間後、2時間後および4時間後にヘパリンを添加した注射筒を用いてラット心臓より採血し、遠心分離(3000rpm, 20分間)により血漿を得た。血漿中のグルコースは酵素法により、またインスリンはワンステップ酵素免疫法によりそれぞれ測定した。血漿中のグルコース及びインスリン濃度を図1及び図2に示す。

【0017】図から明らかなように、対照群の血糖値は投与直後には100mg/dl前後であったが、30分後には250mg/dl前後に上昇し、その後200mg/dl前後の値を維持した。また、インスリン濃度は投与直後には5μU/ml前後であったが、30分後には70μU/ml前後に上昇し、その後は70μU/ml前後に低下した。

【0018】これに対し、実験群では血糖値及びインスリン濃度ともに投与直後の値は対照群と差がなかったものの、30分後以降では血糖値が170mg/dl前後、インスリン濃度が10μU/ml前後であり、対照群よりも有意な低値を示した。この結果より、糖質と共にポリフェノールを投与すると、血糖の上昇が抑制されることが明らかとなった。

【0019】試験例

ポリフェノールとして(-)エピガロカテキンガラートを使用し、急性毒性試験を行った。すなわち、ICR系マウス雄6週令に(-)エピガロカテキンガラートを経口投与した場合、1週間後のLD₅₀は2314mg/kgであった。さらに、ICR系マウス雌5週令に(-)エピガロカテキンガラートを腹腔投与した場合、1週間後のLD₅₀は150mg/kgであった。

【0020】

実施例

錠剤の調製

粗カテキン（又は（-）エピガロカテキンガレート）	100mg
軽質無水ケイ酸	80mg
結晶セルロース	140mg
乳糖	適量
ステアリン酸マグネシウム	2mg

上記粗製量を常法に従い1錠に成型する。

【0021】

【発明の効果】本発明の血糖上昇抑制剤は、日常相当量 10 飲用されている天然物を主成分とするため、薬剤としてはもとより、食品等に添加しても人体に対する副作用の心配がない。しかも、少量の使用により十分な血糖上昇

抑制効果が得られる。

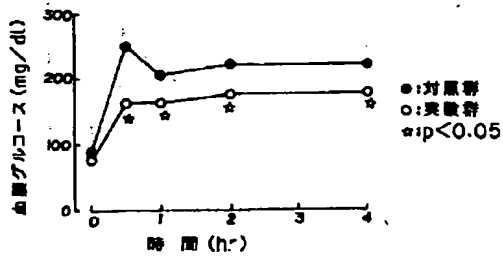
【0022】

【図面の簡単な説明】

【図1】 血漿中のグルコース濃度を示す。

【図2】 血漿中のインスリン濃度を示す。

【図1】



【図2】

